

## 特 許 協 力 条 約

PCT

REC'D 07 APR 2005

WIPO

PCT

特許性に関する国際予備報告 (特許協力条約第二章)

(法第12条、法施行規則第56条)

[PCT36条及びPCT規則70]

出願人又は代理人 の書類記号 ONF-4928PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/002813	国際出願日 (日.月.年) 05.03.2004	優先日 (日.月.年) 06.03.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl <sup>7</sup> C07D209/26, 401/12, 403/12, 405/12, 409/12, 411/12, 413/06, 413/12, 413/14, A61K31/405, 31/422, 31/423, 31/4439, 31/4709, 31/538, 45/06, A61P1/04, 1/16, 7/00, 7/02, 9/00, 11/00, 11/02, 11/06, 11/08,		
出願人 (氏名又は名称) 小野薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。  
法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。
3. この報告には次の附属物件も添付されている。
- a ☐ 附属書類は全部で \_\_\_\_\_ ページである。
- ☐ 補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面の用紙 (PCT規則70.16及び実施細則第607号参照)
- ☐ 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙
- b ☐ 電子媒体は全部で \_\_\_\_\_ (電子媒体の種類、数を示す)。  
配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。
- ☒ 第I欄 国際予備審査報告の基礎
- ☐ 第II欄 優先権
- ☒ 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- ☐ 第IV欄 発明の単一性の欠如
- ☒ 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- ☒ 第VI欄 ある種の引用文献
- ☐ 第VII欄 国際出願の不備
- ☒ 第VIII欄 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 25.05.2004	国際予備審査報告を作成した日 22.03.2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 中木 亜希	4P 9282
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)という国際調査  
☐ PCT規則12.4という国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3という国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に回答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付けて国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 22

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 22 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 22 に記載された発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 22 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

## 第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性(N)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-21, 23	
進歩性(IS)	請求の範囲		有 無
	請求の範囲	1-21, 23	
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-21, 23	有 無
	請求の範囲		

## 2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献1: WO 01/66520 A1

本国際出願の一般式(I)で示される化合物と重複する化合物がDP受容体拮抗剤であり、アレルギー疾患に有効であることが示されている。

文献2: EP 1170594 A2

本国際出願の一般式(I)で、D-R1: CH<sub>2</sub>COOH、R2: メチル基、R3: フッ素、A: メチレン、ring1: ベンゾチアゾール、R4: 水素原子、R5: 水素原子の化合物が記載されている(本国際出願第4頁上部に、斯かる化合物の構造式が示されている。)

\*請求の範囲: 1-21, 23

請求の範囲第1-21項及び第23項に記載の発明は、文献1に対して新規性、進歩性を、文献2に対して進歩性を有しない。

文献1には、本願発明に係る化合物がCRTH2受容体拮抗作用を有することは示されていないが、DP受容体拮抗剤でありアレルギー疾患に有効であることが示されているのだから、本願発明の内容と区別をすることができないものである。

また、文献2に記載の化合物と本国際出願に係る化合物とは、後者(本国際出願の化合物)が本国際出願の一般式(I)でR5を有する点でのみ相違するものである。しかしながら、作用が知られた化合物に各種の置換基を付与した化合物を製造し作用を検討することは、当該技術分野で普通に行われることであり、また、本願発明に係る化合物が文献2に記載の化合物と比較して予想外の格別顕著な効果を奏するものとも認めることができないので、本願発明の進歩性を認めることができない。

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/022813 A1 [EX]	20. 03. 2003	06. 09. 2002	07. 09. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## 第Ⅳ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT第6条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT第5条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。

よって、この国際予備審査報告は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、実施例を中心に作成した。

請求の範囲において、「プロドラッグ」と記載するものであるが、その範囲が不明瞭である。

補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

国際特許分類（IPC）の続き

Int. Cl<sup>7</sup> A61P17/00, 17/04, 17/10, 19/02, 25/06, 25/20, 27/02, 27/12, 27/14, 27/16,  
29/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

PCT/JP2004/002813



Applicant's or agent's file reference ONF-4928PCT	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/JP2004/002813	International filing date (day/month/year) 05 March 2004 (05.03.2004)	Priority date (day/month/year) 06 March 2003 (06.03.2003)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC		
Applicant ONO PHARMACEUTICAL CO., LTD.		

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 7 sheets, including this cover sheet.

3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:

a. ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:

☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).

☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.

b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).

4. This report contains indications relating to the following items:

☒ Box No. I Basis of the report

☐ Box No. II Priority

☒ Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability

☐ Box No. IV Lack of unity of invention

☒ Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

☒ Box No. VI Certain documents cited

☐ Box No. VII Certain defects in the international application

☒ Box No. VIII Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 25 May 2004 (25.05.2004)	Date of completion of this report 22 March 2005 (22.03.2005)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.



# INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/002813

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
  - ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
  - ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ The international application as originally filed/furnished
- ☐ the description:
- pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the claims:
- pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:
- pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/002813

**Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability**

The questions whether the claimed invention appears to be novel, to involve an inventive step (to be non obvious), or to be industrially applicable have not been examined in respect of:

☐ the entire international application.

☒ claim No. 22

because:

☒ the said international application, or the said claim No. 22 relate to the following subject matter which does not require an international preliminary examination (*specify*):

The invention of claim 22 concerns a method for treating the human body by therapy.

☐ the description, claims or drawings (*indicate particular elements below*) or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so unclear that no meaningful opinion could be formed (*specify*):

☐ the claims, or said claims Nos. \_\_\_\_\_ are so inadequately supported by the description that no meaningful opinion could be formed.

☒ no international search report has been established for said claim No. 22

☐ the nucleotide and/or amino acid sequence listing does not comply with the standard provided for in Annex C of the Administrative Instructions in that:

the written form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

the computer readable form

☐ has not been furnished

☐ does not comply with the standard

☐ the tables related to the nucleotide and/or amino acid sequence listing, if in computer readable form only, do not comply with the technical requirements provided for in Annex C-bis of the Administrative Instructions.

☐ see Supplemental Box for further details.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/002813

Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims		YES
	Claims	1-21, 23	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-21, 23	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-21, 23	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations (Rule 70.7)

Document 1 (WO 01/66520 A1) discloses a compound overlapping the compound represented by General Formula (I) of this international application that is a DP receptor antagonist and is effective in the treatment of allergic disease.

Document 2 (EP 1170594 A2) describes the compound of General Formula (I) of this international application wherein D-R1 is a  $\text{CH}_2\text{COOH}$ , R2 is a methyl group, R3 is a fluorine, A is a methylene, ring 1 is a benzothiazole, R4 is a hydrogen atom, and R5 is a hydrogen atom (The structural formula of this compound is shown on the upper part of page 4 of this international application).

\*Claims 1-21 and 23

The inventions of claims 1-21 and 23 lack novelty and an inventive step with respect to document 1, and lack an inventive step with respect to document 2.

Document 1 does not disclose that the compounds of the inventions of this application have CRTH2 receptor antagonism, but because it does disclose that they are DP receptor antagonists that are effective in the treatment of allergic disease, this examination finds those compounds are indistinguishable in content from the compounds of the inventions of the present application.

In addition, when we compare the compounds described in document 2 and the compounds of this international application, the latter (the compounds of this international application) differ only from the standpoint that they include R5 in General Formula (I) of this international application. However, this examination finds that it is conventional practice in this field of technology to prepare compounds by adding various substituents to compounds with a known action and then investigating the action thereof. Moreover, when we compare the compounds of the inventions of the present application with the compounds described in document 2, this examination finds that no particularly outstanding effect is provided thereby that could not be predicted by persons skilled in the art, and therefore the inventions of this application lack an inventive step.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/002813

## Box No. VI Certain documents cited

## 1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/022813 A1 [EX]	20.03.2003	06.09.2002	07.09.2001

## 2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)
--------------------------------	--	---

**Box No. VIII Certain observations on the international application**

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

The scope of claim 1 includes an extremely broad range of compounds, but only a very small number of the claimed compounds are supported by the Description in the sense of PCT Article 6 and fully disclosed in the sense of PCT Article 5.

As a result, this international preliminary examination report was prepared focusing on the compounds that are supported and fully disclosed in the Description, i.e., the compounds in the Examples.

Moreover, the term "prodrug" is used in the claims, but the scope of that term is unclear.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/JP2004/002813

Supplemental Box

In case the space in any of the preceding boxes is not sufficient.

Continuation of International Patent Classification (IPC)

Int. Cl<sup>7</sup> A61P17/00, 17/04, 17/10, 19/02, 25/06, 25/20, 27/02, 27/12, 27/14, 27/16,  
29/00, 37/02, 37/06, 37/08, 43/00